

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成29年4月13日 (2017.4.13)

【公開番号】特開2016-199602(P2016-199602A)

【公開日】平成28年12月1日 (2016.12.1)

【年通号数】公開・登録公報2016-066

【出願番号】特願2016-174293(P2016-174293)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/519	(2006.01)
A 6 1 K	9/22	(2006.01)
A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 K	47/38	(2006.01)
A 6 1 K	47/36	(2006.01)
A 6 1 K	47/32	(2006.01)
A 6 1 K	47/26	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/04	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	5/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	35/02	(2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K	31/519	
A 6 1 K	9/22	
A 6 1 K	47/10	
A 6 1 K	47/38	
A 6 1 K	47/36	
A 6 1 K	47/32	
A 6 1 K	47/26	
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	37/04	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	11/06	

A 6 1 P 5/00  
A 6 1 P 1/04  
A 6 1 P 25/28  
A 6 1 P 35/02  
A 6 1 P 29/00

【手続補正書】

【提出日】平成29年3月6日(2017.3.6)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

1 1 m g のトファシチニブまたは同量のトファシチニブを含む薬学的に許容できるその塩、およびオスマゲンを含むコア、  
およびコアを囲む半透膜コーティングを含む、前記コーティングが水不溶性ポリマーを含む、前記水不溶性ポリマーがセルロース誘導体である、  
対象に投与されたとき、投与後の血漿濃度対時間曲線下平均面積が、投薬されたトファシチニブ 1 m g あたり 1 7 n g - h r / m L ~ 投薬されたトファシチニブ 1 m g あたり 4 2 n g - h r / m L であり、幾何平均血漿 C m a x の C m i n に対する比が 1 0 ~ 1 0 0 である、  
1 日 1 回の持続放出医薬剤形。

【請求項 2】

平均定常状態最小血漿濃度 ( C m i n ) が、投薬されたトファシチニブ 1 m g あたり 0 . 3 n g / m L 未満である、  
請求項 1 の 1 日 1 回の持続放出医薬剤形。

【請求項 3】

血漿濃度対時間曲線下面積の摂食時 / 絶食時平均比が 0 . 7 ~ 1 . 4 であり、最大血漿濃度 ( C m a x ) の摂食時 / 絶食時平均比が 0 . 7 ~ 1 . 4 である、  
請求項 1 の 1 日 1 回の持続放出医薬剤形。

【請求項 4】

1 1 m g のトファシチニブまたは同量のトファシチニブを含む薬学的に許容できるその塩、およびオスマゲンを含むコア、  
およびコアを囲む半透膜コーティングを含む、前記コーティングが水不溶性ポリマーを含む、前記水不溶性ポリマーがセルロース誘導体である、  
標準の USP 回転パドル装置において 3 7 で、0 . 0 5 M の p H 6 . 8 リン酸カリウム緩衝液 9 0 0 m L を含む試験媒質に加え、パドルを 5 0 r p m で回転させたとき、  
1 時間でトファシチニブまたは薬学的に許容できるその塩の 3 0 % 以下、  
2 . 5 時間でトファシチニブまたは薬学的に許容できるその塩の 3 5 % 以上かつ 7 5 % 以下、  
5 時間でトファシチニブまたは薬学的に許容できるその塩の 7 5 % 以上が溶解する、  
1 日 1 回の持続放出医薬剤形。

【請求項 5】

1 1 m g のトファシチニブまたは同量のトファシチニブを含む薬学的に許容できるその塩、およびオスマゲンを含むコア、  
およびコアを囲む半透膜コーティングを含む、前記コーティングが水不溶性ポリマーを含む、前記水不溶性ポリマーがセルロース誘導体である、  
対象に経口投与されたとき、A U C が、即時放出製剤 B I D として投与される 5 m g のト

ファシチニブまたは同量のトファシチニブを含む薬学的に許容できるその塩のAUCの80%～125%の範囲となり、幾何平均血漿CmaxのCminに対する比が10～100となる、

1日1回の持続放出医薬剤形。

【請求項6】

AUC範囲が90%～110%であり、幾何平均血漿濃度CmaxのCminに対する比が20～40である、請求項5に記載の医薬剤形。

【請求項7】

幾何平均血漿濃度CmaxのCminに対する比が20～30である、請求項6に記載の医薬剤形。

【請求項8】

前記剤形が対象に経口投与されたとき、平均血漿Cmaxが、定常状態で、即時放出製剤BIDとして投与されるトファシチニブの平均血漿Cmaxの70%～125%の範囲となる、請求項5から7のいずれか一項に記載の医薬剤形。

【請求項9】

前記剤形が対象に経口投与されたとき、ドラッグホリデーが、24時間の間で、即時放出製剤BIDとして投与されるトファシチニブのドラッグホリデーの80%～110%の範囲となる、請求項5から8のいずれか一項に記載の医薬剤形。

【請求項10】

ドラッグホリデーが、24時間の間で15～18時間である、請求項5に記載の医薬剤形。

【請求項11】

幾何平均血漿CmaxのCminに対する比が20～40である、請求項1に記載の医薬剤形。

【請求項12】

幾何平均血漿CmaxのCminに対する比が20～30である、請求項1に記載の医薬剤形。

【請求項13】

対象において、24時間の投薬区間で、17ng/mlを上回る単一連続時間が6～15時間であり、17ng/mlを下回る単一連続時間が9～18時間である、請求項1に記載の医薬剤形。

【請求項14】

対象において、平均最大血漿濃度(Cmax)が、投薬されたトファシチニブ1mgあたり3ng/mL～投薬されたトファシチニブ1mgあたり6ng/mLである、請求項1に記載の医薬剤形。

【請求項15】

前記剤形の送達系が、押出性コア系、膨潤性コア系、および非対称膜技術からなる群から選択される、請求項1～14のいずれか一項に記載の医薬剤形。

【請求項16】

前記セルロース誘導体が酢酸セルロースである、請求項1～15のいずれか一項に記載の医薬剤形。

【請求項17】

コーティングが、平均分子量が2000～100,000ダルトンの間である水溶性ポリマーをさらに含む、請求項1～16のいずれか一項に記載の医薬剤形。

【請求項18】

前記水溶性ポリマーが、水溶性セルロース誘導体、アカシア、デキストリン、グアーガム、マルトデキストリン、アルギン酸ナトリウム、デンプン、ポリアクリレート、およびポリビニルアルコールからなる群から選択される、請求項17に記載の医薬剤形。

【請求項19】

前記水溶性セルロース誘導体が、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピル

メチルセルロース、またはヒドロキシエチルセルロースを含む、請求項 1 8 に記載の 医薬 剤形。

【請求項 2 0】

オスマゲンが糖である、請求項 1 ~ 1 9 のいずれか一項に記載の 医薬 剤形。

【請求項 2 1】

糖がソルビトールである、請求項 2 0 に記載の 医薬 剤形。